

# 27P-am10S

## NEXTA 反応を用いた 18F 標識アミノ酸導入法の開発

○古川 武典<sup>1</sup>, 木村 寛之<sup>1</sup>, 有光 健治<sup>1</sup>, 戸田 力也<sup>1</sup>, 徳田 安則<sup>2</sup>, 河嶋 秀和<sup>1</sup>, 瀧 真清<sup>3</sup>, 佐治 英郎<sup>4</sup>, 安井 裕之<sup>1</sup> (1 京都薬大, 2 筑波大医学医療系, 3 電通大, 4 京大院薬)

【目的】陽電子放出断層撮影 (PET)、単光子放出断層撮影 (SPECT) 用分子イメージングプローブの開発において、迅速かつ効率的な標識法の開発は重要な研究課題の一つである。一方、近年バイオ医薬品としてペプチド製剤が注目されていることから、ペプチドを母体とした分子イメージングプローブの開発も盛んに進められている。そこで本研究では、天然もしくは非天然アミノ酸をペプチド・タンパク質の N 末端リシン残基に選択的かつ短時間で導入可能なアミノ酸導入法である N-terminal Extension of protein by Transferase and Aminoacyl tRNA synthetase (NEXTA 反応) に着目し、放射性標識アミノ酸を NEXTA 反応により導入する新規の放射性アミノ酸導入法 (RI-NEXTA 反応) の開発を計画した。

【方法】先ず、非標識体を用いた検討を行った。NEXTA 反応により、非天然アミノ酸である *O*-(2-fluoroethyl)-L-tyrosine (FET) の Kallidin-cyclo-RGD (インテグリン  $\alpha V \beta 3$  レセプターへの親和性が知られている化合物) への導入を検討した。条件として 37°C、30 分間で反応を進行させた。続いて、前述の条件を基に放射性標識アミノ酸 [<sup>18</sup>F]FET を用いて RI-NEXTA を検討した。さらに反応時間 5、30 分における反応効率を検証した。

【結果・考察】NEXTA 法および RI-NEXTA 法によって、FET および [<sup>18</sup>F]FET をそれぞれ Kallidin-cyclo-RGD に導入できたことを HPLC 分析によって確認した。また、RI-NEXTA 法における反応効率は、反応時間 5、30 分でそれぞれ 15 %、91 %であった。すなわち、放射性標識アミノ酸を用いる RI-NEXTA 反応においても短時間で進行することが示された。現在は、得られた放射性標識ペプチドの分子プローブとしての有用性の評価を進めている。